(19)日本国特許庁 (JP)

(12)公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平6-24956

(43)公開日 平成6年(1994)2月1日

(51) Int. Cl. s'

識別記号

FΙ

A61K 7/48

7/00

9051-4C

H 9164-4C

J 9164-4C

W 9164-4C

U 9164-4C

審査請求 未請求 請求項の数2 (全9頁) 最終頁に続く

(21)出願番号

特願平4-227723

(71)出願人 000001959

株式会社資生堂

東京都中央区銀座7丁目5番5号

(22)出願日

平成4年(1992)7月13日

(72)発明者 柳田 威

神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株

式会社資生堂研究所内

(72)発明者 阪本 興彦

神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株

式会社資生堂研究所内

(54) 【発明の名称】皮膚外用剤

(57)【要約】

【目的】肌荒れ改善効果の相乗的に向上した皮膚外用剤 を提供することを目的とする。

【構成】ビタミンAとポリオキシアルキレン変成オルガ ノポリシロキサンを配合。

2

【特許請求の範囲】

【請求項1】ビタミンAとポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンとを含有することを特徴とする皮膚外用剤。

【請求項2】ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンが、下記一般式、化Iで表される化合物より選ばれたものである請求項1記載の皮膚外用剤。 【化I】

【発明の詳細な説明】

[0001]

【産業上の利用分野】本発明は皮膚外用剤に関し、さらに詳しくはピタミンAとポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンとを含有することによりピタミンAのもつ肌荒れ改善効果を相乗的に向上させるとともに安全性にも配慮した皮膚外用剤に関する。

<u>.</u>

[0002]

【従来の技術】皮膚外用剤には種々の薬効成分が配合されている。その中で皮膚の加齢、あるいは日光暴露等による変化を予防、改善する効果も薬効の一つであり、これらを目的とする化粧料等の皮膚外用剤が求められてきた。

【0003】こうした中で従来は、天然物から抽出した 各種原料、例えばタンパク質、多糖、抽出エキス、天然 高分子等がその使用効果が特徴的であるため皮膚外用剤

に配合されてきた。

【0004】近年、ピタミンAおよびその誘導体の中か ら選ばれる一種または二種以上を配合し、皮膚の加齢あ るいは日光暴露による変化、あるいは障害を防止、改善 する方法が開陳されている。(特表昭64-50035 5)

[0005]

【発明が解決しようとする課題】

従来技術の問題点

果のある薬効剤の開発が待望されていた。

【0006】発明の目的

本発明は前記従来技術の問題点に鑑みなされたものであ り、その目的は、皮膚の加齢あるいは日光暴露による変 化、あるいは障害に対する防止効果、改善効果等の肌荒 れ改善効果を十分発揮させる皮膚外用剤を提供すること

【0007】前記目的を達成するために、本発明者らは 安全性に優れた物質の中から、特に十分な肌荒れ改善効 果を発現させる物質を得るべく鋭意研究を重ねた結果、 ビタミンAと共にポリオキシアルキレン変性オルガノポ リシロキサンを配合することによって、これら問題点を 解決することを見出した。

【0008】本発明者らは上記知見に基いて本発明を完 成するに至った。

[0009]

【課題を解決するための手段】すなわち、本発明はピタ ミンAとポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキ サンとを含有することを特徴とする皮膚外用剤を提供す るものである。以下、本発明の構成について詳述する。

【0010】本発明に用いられるビタミンAは別名をレ チノールとも言い、通常、医薬品分野等で小児病、夜盲 しかしながら、その効果は十分ではなく、より優れた効 10 症の治療や妊娠後の回復剤として利用されている。これ らの中でall-trans体もしくは13-cis体 を用いることが望ましく、それらの混合物を使用しても かまわない。

> 【0011】本発明の皮膚外用剤へのピタミンAの配合 量については限定はしないが、ピタミンAの肌への効果 を考えると0.0001重量%~5.0重量%が好ま しく、0.0001重量%~0.5重量%がより好まし 64

[0012] 本発明に用いられるポリオキシアルキレン 20 変性オルガノポリシロキサンは、下記一般式、化 I で表 される化合物である。

[0013]

[化1]

8 Ü [0] - (CH2) .0 (C3H60) , (C2H40) xR' ٦ ح (CH2),0(C3H60),(C2H40),R' も20% 水至で (CH2),0(C3H6D),(C2H4D)xR' _ (ch2) p0 (c3H60) y (C2H40) xR± ひはなり SE E **化效乃** 日曜日 8 よのは ı アロッ のまれ 又乃よ ~ - 4 (CH2) ,0 (C3H60) , (C2H40) xR (CH2) 00 (C3H60) 7 (C2H40) xR ţ 菱はて **∻** △ ル茶菜 A 2 G œ-648 密から 至アカ 乃の1 급합 ₩ × (OC8H4) x (OC3H8) y O (CH3) R' (0C2H4) x (0C3H6) y 0 (CH2) 素乃び 吹きよ 法额件 **化聚口** · X. 中は数 式又整 S ŧ € 7 œ

40

50

【0014】本発明に用いられるポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンの平均分子量は特に限定しないが、3000以上を有するものが好ましく、更に好ましくは5000以上である。また、ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン分子中にポリオキシアルキレン基を2~80重量%含有するものが好ましく、効果発現の面から更に好ましくは、11~50重量%である。

【0015】ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンの配合量は、皮膚外用剤全量中、0.1~20 重量%、好ましくは0.2~10重量%である。0.1 重量%未満では皮膚刺激性が低くならない。また、20 重量%を越えると皮膚外用剤としての品質が保てなくなる。

【0016】本発明の皮膚外用剤は前記の必須成分に加えて、必要に応じ、本発明の効果を損なわない範囲内で、化粧料、医薬部外品、医薬品等に一般に用いられる各種成分、水性成分、保湿剤、増粘剤、紫外線吸収剤、防腐剤、酸化防止剤、香料、色剤、薬剤、生薬、等が配合される。もちろんこれらは本発明の目的を損なわない質的、量的条件下で使用されなければならない。

[0017] また本発明の皮膚外用剤の剤型は任意であり、例えば化粧水等の可溶化系、乳液、クリーム等の乳化系あるいは軟膏、粉末分散系、水ー油二層系、水ー油

-粉末三層系等どのような剤型でもかまわない。

[0018]

【実施例】次に実施例および比較例をあげて、本発明を 具体的に明らかにする。尚、本発明はこれにより限定さ れるものではない。配合量は重量%である。

[0019] <<実施例1~5>>下記組成のクリーム を製造し、肌荒れ改善効果について検討した。尚、配合 したポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン は下記表1に記載したものを使用した。

(1) セトステアリルアルコール	3. 5
(2) スクワラン	30.0
(3) ミツロウ	3. 0
(4) 還元ラノリン	5. 0
(5) エチルパラベン	0.3
(6) ポリオキシエチレン(50モル)オレイルアルコー	-ルエーテル
	2. 0
(7) ステアリン酸モノグリセリド	2. 0
(8) ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン	/ (表1に記載)
	3. 0
(9) 香料	0.03
(10) ピタミンA	0.0001
(11) グリセリン	15.0
(12)精製水	残余

製法

(1), (2), (3), (4), (5), (6),

(7)、(8)、(9)、(10)を加熱溶解し、75 ℃に保ったものを75℃に加温した(11)、(12) に撹拌しながら加える。ホモミキサーで撹拌乳化しなが ら冷却してクリームを得た。

20 オキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンを除いた 以外は全て同じ処方。

【0021】<<比較例2>>実施例1の処方からピタ ミンAを除いた以外は全て同じ処方。

[0022] 【表 1 】

【0020】<<比較例1>>実施例1の処方からポリ

	ポリオキシアルキレン変性
	オルガノシロキサン
実施例1	ー般式[A] ポリオキシエチレン基20重量%
	分子量6000
実施例2	一般式[A] ポリオキシエチレン基40重量% 分子量20000
実施例3	一般式[B] ポリオキシエチレン基60重量% 分子量10000
実施例4	一般式[C] ポリオキシエチレン基20重量% ポリオキシプロピレン基10重量% 分子量4000
実施例5	一般式[A] ポリオキシエチレン基15重量% 分子量2500

【0023】 <肌荒れ改善試験方法>乾癬様、肌荒れ様 の皮膚疾患を有する被験者100名をパネルとして5群 に分け、1群(1群20名)ごとに実施例1~5及び比 較例1~2のクリームを使用させた。すなわち実施例1 ~5を、パネルの左顔面へ1日2回ずつ塗布し、比較例 50 【表2】

1と比較例2のクリームを右顔面に塗布させ、3ケ月連 続使用後、使用前に比べて使用後の全般改善度を肉眼判 定した。その結果を表2に示す。

[0024]

}

全般改善度				実		施	例					比	較多	74
		L	- 2	2		3	4	1	ш,	5			2	
	乾	肌荒れ	乾癬	肌荒れ	乾癬	肌荒れ	乾癬	肌荒れ	乾癬	肌荒れ	乾癬	肌荒れ	乾癬	肌荒れ
かなり改善	7	6	6	6	6	7	6	6	5	5	0	0	0	0
やや改善	2	2	3	. 2	1	2	2	2	3	3	4	4	1	1
変化なし	1	2	1	2	3	1	2	2	2	2	19	19	24	24
悪化	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	2	0	0
合計(人数)	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10	25	25	25	25

【0025】表2の結果から明らかなように実施例1~

90

80

90

80

70

90

た。

80

5の本発明品は比較例1、比較例2のものに比べて相乗

[0026]

80

80

80

16 | 16

的に優れた肌荒れ改善効果を有していることがわかっ

(やや改善

以上のもの)

実施例6	化粧水			重量%
(1) ピタミ	ンA		0.	00001
(2) ポリオ=	キシアルキレン変性			
	オルガノポリシロキ!	ナン* 1	0.	1
(3) グリセリ	リン		1.	0
(4)精製水			残	余
(5) エタノ-	ール		7.	0
(6)ポリオ=	キシエチレン(50モ)	レ) オレイルアルコールエー	テル	V
			1.	0
(7) メチル/	パラペン		0.	0 5
(8) オレイ)	ルアルコール		1.	0
(9) 乳酸			0.	01 ·
(10)乳酸:	ナトリウム	•	0.	1
(11) 香料			0.	0 1

(製法)精製水に(3)、(9)、(10)を溶解する。別にエタノールに(1)、(2)、(6)、

40 本発明の化粧水は肌荒れ改善効果に優れていた。 【0027】

(7)、(11)を溶解し、これを前記の精製水に加えて溶解し濾過し化粧水を得た。

★1 一般式[B]

ポリオキシエチレン基60里量% 分子量10000

実施例7 パック

重量%

(1) ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン *2 3.0

(7)	特開平6-24956
11	12
(2) ポリピニルアルコール	10.0
(3) プロピレングリコール	7. 0
(4)エタノール	10.0
(5) ピタミンA	0.01
(6) メチルパラベン	0.05
(7) POE (60モル) 硬化ひまし油	0. 2
(8) 香料	0.05
(9) 精製水	残余
7	製法
- 般式[A] 10	(9) に(1)、(3)、(6)、(7)を加え撹拌溶
ポリオキシエチレン基40重量%	解する。次に(2)を加え加熱撹拌し、(9)を溶解し
分子量8000	た、(4)を加え撹拌溶解してパックを得た。本発明の
), <u>m</u> 0000	バックは皮膚改善効果に優れていた。
	[0028]
実施例8 固型白粉	重量%
(1) ビタミンA	0.0005
(2)タルク	8 5. 4

実施	函例 8	固型白粉		1
(1)	ピタミン	<i>A</i> .	0.	0 0 0
 (2)	タルク		85.	4
(3)	ステアリン	ン酸	2.	5
(4)	スクワラ	·	3.	5
(5)	ソルピタン	ンセスキオレイン酸エステル	1.	8
(6)	トリエタ	ノールアミン	1.	2
(7)	ポリオキ	ンアルキレン変性オルガノポリシロキサン	* 3	
			10.	0
(8)	顔料		i	適量
(9)	香料		j	

‡3

:2

般式[B] ポリオキシエチレン基60重量% 分子量4000

製法

タルク、顔料をニーダーで十分混合する。(粉末部)ト リエタノールアミンを50%相当量の精製水に加え70

℃に保つ。 (水相) 香料を除く本発明かの成分を混合 し、加熱溶解して70℃に保つ。(油相)水相に油相を 加えホモミキサーで均一に乳化し、これを粉末部に加え ニーダーで練り併せた後、水分を蒸発させ粉砕機で処理 30 する。さらにこれをよく掻き交ぜながら香料を均一に噴 霧し圧縮成形する。本発明の固型白粉は皮膚に対する改 善効果に優れていた。

[0029]

200%们当里 少得 数水气加火,0	
実施例9 口紅	重量%
(1) ピタミンA	0.00001
(2) マイクロクリスタリンワックス	3. 0
(3) ミツロウ	3. 0
(4) セレシンワックス	5. O
(5)流動パラフィン	19.0
(6) スクワラン	20.0
(7) カルナバロウ	3. 0
(8) キャンデリラロウ	3. 0
(9) ポリオキシアルキレン変性オルガノポ	リシロキサン *4
	1. 0
(10) 調合色剤	7. 0
(11) ジブチルヒドロキシトルエン	0.05
(12) 香料	適量
(13) ラノリン	残余

特開平6-24956

13

*4

-般式[A] ポリオキシエチレン基60重量% 分子量25000

製法

常法により口紅を得た

本発明の口紅はくちびるのかさつきを著しくおさえてい

[0030]

実施例10 乳液	重量%
(1) ピタミンA	1. 0
(2) ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン	* 5
•	1. 0
(3) エタノール	2. 0
(4) グリセリン	10.0
(5) プロピレングリコール	3. 0
(6) カルポキシビニルポリマー	0.3
(7) KOH	0.1
(8) メチルパラベン	0.1
(9) セタノール	2. 5
(10) ワセリン	2. 0
(11) スクワラン	10.0
(12) イソプロピルミリステート	5. 0
(13) グリセリルモノステアレート	2. 0
(14) POE (25モル) セチルエーテル	2. 0
(15)精製水	残余
* 5	
一般式[C]	

ポリオキシエチレン基15重量% ポリオキシプロピレン基10重量% 分子量5000

製法	改善効果に優れていた。		
常法により本発明の乳液を得た。本発明の乳液は肌荒れ	[0031]		
実施例11 乳液	·	重星	<u>t</u> %
(1) ピタミンA		0.	3
(2) ポリオキシアルキレン変性オルガ	ノポリシロキサン *6		
		0.	2
(3) エタノール		5.	0
(4) グリセリン		5.	0
(5) プロピレングリコール		5.	0
(6) カルボキシビニルボリマー		0.	2
(7) KOH		0.	0 6
(8) メチルパラベン		0.	2
(9) POE (60モル) 硬化ひまし油		1.	0
(10) スクワラン		3.	0
(11) イソプロピルミリステート		3.	0
(12)精製水		殍	余

特開平6-24956

16

#6

一般式[D]

ポリオキシエチレン基40重量% 分子量7000

15

製法

常法により本発明の乳液を得た。本発明の乳液は、皮膚改善効果に優れていた。

[0032]

実施例12 ナイトクリーム	重量%
(1) スクワラン	20.0
(2) 流動パラフィン	10.0
(3) イソプロピルミリステート	6.0
(4) ブチルパラベン	0.2
(5) ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン	*7 3.0
(6) ジグリセリンジイソステアレート	1. 0
(7) ワセリン	4. 0
(8) 固形パラフィン	2. 0
(9) ピタミンA	0.3
(10) プロピレングリコール	4. 0
(11) グリセリン	10.0
(12) 硫酸マグネシウム	0.3
(13) 精趣水	残余

*7

一般式[A]

ポリオキシエチレン基20軍量% 分子量6000

製法

常法により本発明のナイトクリームを得た。本発明のナイトクリームは、皮膚改善効果に優れていた。

[0033]

【発明の効果】本発明の皮膚外用剤はは表皮障害を防止 し、皮膚の加齢あるいは日光暴露による変化、あるいは 障害を防止、改善する効果等の肌荒れ改善を相乗的に向 上させ安全性にも配慮した皮膚外用剤である。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. 5

識別記号 庁内整理番号

FΙ

技術表示箇所

A 6 1 K 7/02 7/025 Z 9164-4C

9164-4C